(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



(43) 国際公開日 2001 年1 月4 日 (04.01.2001)

PCT

(10) 国際公開番号 **WO 01/00599 A1**

(51) 国際特許分類⁷: C07D 263/10, 263/32, 277/10, 277/30, 265/08, 279/04, 233/64, 413/12, 417/12, A01N 43/76, 43/78, 43/86, 43/54

(21) 国際出願番号:

PCT/JP00/04135

(22) 国際出願日:

2000年6月23日(23.06.2000)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ: 特願平11/179999 1999年6月25日(25.06.1999)

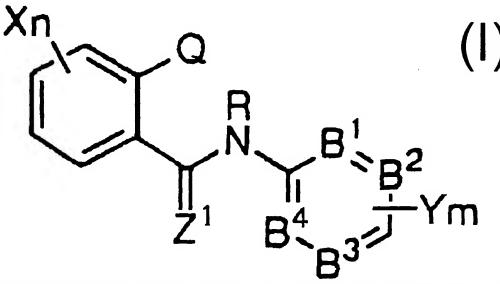
(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 日本農 薬株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒103-8236 東京都中央区日本橋1丁目2番5号 Tokyo (JP). (72) 発明者; および

- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 古谷 敬 (FU-RUYA, Takashi) [IP/IP]; 〒598-0021 大阪府泉佐野市日根野2821 Osaka (JP). 河野栄司 (KOHNO, Eiji) [JP/IP]; 〒494-0013 愛知県尾西市玉野字杁ノ戸48-1 Aichi (JP). 遠西正範 (TOHNISHI, Masanori) [JP/IP]; 〒599-8123 大阪府堺市北野田296-1-201 Osaka (JP). 坂田和之 (SAKATA, Kazuyuki) [JP/IP]; 〒586-0022 大阪府河内長野市本多町5-6-301 Osaka (JP). 森本雅之 (MO-RIMOTO, Masayuki) [JP/IP]; 〒586-0024 大阪府河内長野市西之山町1-28-305 Osaka (JP). 瀬尾 明 (SEO, Akira) [JP/IP]; 〒648-0092 和歌山県橋本市紀見ヶ丘2-3-19 Wakayama (JP).
- (74) 代理人: 浅村 皓、外(ASAMURA, Kiyoshi et al.); 〒 100-0004 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 新大手町 ビル331 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,

/続葉有/

(54) Title: BENZAMIDE DERIVATIVES, INSECTICIDES FOR AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL USE AND USAGE THEREOF

(54) 発明の名称: ベンズアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法



(57) Abstract: Benzamide derivatives represented by general formula (1); and insecticides for agricultural and horticultural use and usage thereof wherein Z^1 is O or S; R is H, (substituted) alkyl, or alkoxycarbonyl; X is halogeno, cyano, nitro, C_3 - C_6 (halo) cycloalkyl, (substituted) phenyl, a (substituted) heterocyclic group, or -A¹-R¹ [wherein A¹ is -O-, -S-, -SO-, -SO₂-, -C(=O)-, or -C(=NOR₂)-(wherein R² is H, C_1 - C_6 (halo)alkyl, (substituted) phenylated C_1 - C_4 alkyl, or the like); and R¹ is halogeno, C_3 - C_6 cycloalkyl, C_3 - C_6 halocycloalkenyl, (substituted) phenyl, or the like]; n is 0 to 4; Y is halogeno, cyano, nitro, C_3 - C_6 halocycloalkyl, (substituted) phenyl, or the like; m is 1 to 5; Q is a heterocycle such as oxazoline; and B¹ to B⁴ are each CH or N.

/続葉有)

DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,

LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

一 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

· --· 般 式 (1):

$$X_{N}$$
 A_{N}
 A_{N

【式中、 Z¹は 0, S RはH、(置換)アルキル、アルコキシカルボニル、Xはハロゲン、シアノ、ニトロ、(ハロ)C3 - C6シクロアルキル、(置換)フェニル、(置換)複素環、-A¹-R¹(A¹は-0-、-S-、-S0-、-S02-、-C(=0)-、-C(=NOR2)-(R2はH、(ハロ)C1-C6アルキル、(置換)フェニルC1-C4 アルキル等、R¹はハロ、C3-C6 シクロアルキル、ハロC3-C6シクロアルケニル、(置換)フェニル等、nは0~4、Yはハロゲン、シアノ、ニトロ、ハロ C3 - C6 シクロアルキル、(置換)フェニル等、mは1~5、Qはオキサゾリン等の複素環、B1~B4はCHまたはN〕で表されるベンズアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関する。

明 細 書

ベンズアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

5 技術分野

本発明は新規なベンズアミド誘導体及び該誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

背景技術

特開平5-1060号公報、特表平9-507497号公報、特開平6-41 10 093号公報、特開平8-92224号公報等に本発明のベンズアミド誘導体に 類似の殺虫・殺ダニ活性化合物が開示されているが、ヘテロ環が結合したベンゼ ン環上の置換基としてアミド結合を有する化合物は記載されていない。

本発明者らは新規な農園芸用薬剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明 の一般式(I) で表されるベンズアミド誘導体は文献未記載の新規化合物であり、

15 農園芸用殺虫剤として新規な用途を見出し、本発明を完成させたものである。

発明の開示

本発明は一般式(I):

{式中、 Z^1 は酸素原子又は硫黄原子を示し、Rは水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基から選択される 1 以上の置換基で置換された C_1 - C_6 アルキル基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基を示す。

Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、同一又は異なっても良いト

リ C_1 - C_6 アルキルシリル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 -

- C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、 ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニ
- 10 ル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^1$ - R^1 (式中、 A^1 は-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2$ -、-C(=O) -、-C(=N0 = 02)、 (オウ、 $-C_1$ 2 は +A = 02 は +A = 02 に +A = 03 に +A = 04 に +A = 04 に +A = 05 に

 OR^2) - (式中、 R^2 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、

- 15 C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル C_1 - C_4 アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルス
- 20 ルホニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1 - C_4 アルキル基を示す。)、 C_1 - C_6 アルキレン基、ハロ C_1 - C_6 アルキレン基、 C_2 - C_6 アルケニレン基、ハロ C_2 - C_6 アルケニレン基、 C_2 - C_6 アルキニレン基又は ハロ C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、
- (1) A^1 が-O-、-S-、-SO-又は $-SO_2-$ を示す場合、 R^1 はハ C_3-C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3-C_6 シクロアルケニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルメルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基又はハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基又はハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル

C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル 基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C6アルキル基、 ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフ 5 ィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル 基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有す る置換複素環基又は $-A^2-R^3$ (式中、 A^2 は C_1-C_6 アルキレン基、ハロ C_1 - C_6 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルケニレン基、ハロ C_3 - C_6 アルケニレン基、 C_3 - C_6 アルキニレン基又はハロ C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、R³ は水素原子、 10 ハロゲン原子、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 -C₆アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン 原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハ ロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 -15 C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基又は $-A^3-R^4$ (式中、 A^3 は-O-、 -S-、-SO-、 $-SO_2-$ 又は-C (=O) -を示し、 R^4 は C_1-C_6 アル キル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、 C₃-C₆アルケニル基、ハロ C₃-C₆アルケニ ル基、 C₃-C₆シクロアルキル基、ハロ C₃-C₆シクロアルキル基、フェニル基、 20 同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキル チオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェ 25 ニル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆ア ルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、 C₁-C₆アルコキシ基、ハロ C₁-C₆アルコ キシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキ ルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルス

ルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換

基を有する複素環基を示す。)を示す。)を示し、

- (2) A¹ が-C (=O) -又は-C (=NOR²)- (式中、R² は前記に同 じ。)を示す場合、 R^1 は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキ ル基、 C₂-C₆アルケニル基、ハロ C₂-C₆アルケニル基、 C₃-C₆シクロアルキ 5 ル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキル チオ基、モノ C₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C₁-C₆ア ルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁- C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アル キルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上 の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、 ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキ シ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキ ルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニ ル基、 C1-C6アルキルスルホニル基又はハロ C1-C6アルキルスルホニル基か ら選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、複素環基又 は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁- C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 ア 20 ルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C1-C6アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基 を示し、
- (3) A^1 が C_1 - C_6 アルキレン基、ハロ C_1 - C_6 アルキレン基、 C_2 - C_6 アル C_6 アルキニレン基、ハロ C_2 - C_6 アルケニレン基、 C_2 - C_6 アルキニレン基又はハロ C_3 - C_6 アルキニレン基を示す場合、 R^1 は水素原子、ハロゲン原子、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル 基、同一又は異なっても良いトリ C_1 - C_6 アルキルシリル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル

ル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ 基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複

- 5 素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル 基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又は ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換
- 15 ルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、
- C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アル
 - キルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^5$ - R^6 (式中、 A^5 は C_1 - C_6 アルキレン基、ハロ C_1 - C_6 アルキレン基、 C_2 - C_6 アルケニレン基、ハロ C_2 - C_6 アルキニレン基又はハロ C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、
- 25 R^6 は水素原子、ハロゲン原子、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原

子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 -C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良 く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アル コキシ基、ハロ C₁-C₆アルコキシ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆ア ルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフ ィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル 基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、 10 同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆ア ルキル基、 C₁-C₆アルコキシ基、ハロ C₁-C₆アルコキシ基、 C₁-C₆アルキル チオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 -15 С6アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル

15 C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカール基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。)を示す。)を示す。〕を示す。

nは $0\sim4$ の整数を示す。又、Xはフェニル環上の隣り合った炭素原子と一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ 基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6

アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルカルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカーニルを選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基から選択される 1 以上の置換基を有することもでき 10 る。

 B^{1} 、 B^{2} 、 B^{3} 及び B^{4} は同一又は異なっても良く、窒素原子又は炭素原子 を示し、Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハ ロ C₃-C₆シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン 原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハ ロ C₁-C₆アルコキシ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 15 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、 ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、 C₁-C₆アルコキ シ基、ハロ C₁-C₆アルコキシ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキ 20 ルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニ ル基、C1-C6アルキルスルホニル基又はハロ C1-C6アルキルスルホニル基から 選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^1-R^1$ (式中、 A^1 及び R^1 は前記に同じ。)を示し、mは $1\sim5$ の整数を示す。

25 又、Yはフェニル環上の隣り合った炭素原子と一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスル

Qは $Q^1 \sim Q^8$ で表される以下のヘテロ環を示す。

15
$$\stackrel{N}{\longrightarrow} R^7 p$$
 $\stackrel{N}{\longrightarrow} R^7 p$ $\stackrel{N}{\longrightarrow} R^8 p$ $\stackrel{N}{\longrightarrow} R$

(式中、Wは酸素原子、硫黄原子又は-N(R^8)-(式中、 R^8 は C_1 - C_6 アルキル基、 D_1 - D_6 アルキル基、 D_1 - D_6 アルキル基、 D_1 - D_6 アルキル基、 D_1 - D_6 アルキルチオ D_1 - D_6 アルキルチオ D_1 - D_6 アルキル基、 D_1 - D_6 アルキル基、 D_1 - D_6 アルキル基、 D_1 - D_6 アルキル基、 D_1 - D_6 アルキルスルフィニル D_1 - D_6 アルキル基、 D_1 - D_6 アルキルスルフィニル D_1 - D_6 アルキルスルホニル D_1 - D_6 アルキル基、 D_1 - D_1 -D

ン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 ハロ C₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ 基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択さ 5 れる1以上の置換基を有する置換フェニル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ C₁-C₆アルキルアミ ノカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原 子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ 10 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 -C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、フェニル C₁-C₄アルコキ シカルボニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アル 15 キル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキ シ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキル スルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスル ホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基 を環上に有する置換フェニル C_1 - C_4 アルコキシカルボニル基を示す。)を示す。 R^7 は $-(A^6)$ r-G, (式中、 A^6 は C_1-C_8 アルキレン基、 C_3-C_6 ア 20 ルケニレン基又は C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、rは0又は1の整数を示し、 Gは同一又は異なっても良く水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハ ロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル 基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アル コキシホスホリル基、同一又は異なっても良いジ C₁-C₆アルコキシチオホスホ 25 リル基、ジフェニルホスフィノ基、ジフェニルホスホノ基、フェニル基、同一又 は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル 基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 ア

ルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキル スルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、ビフェニ ル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁- C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 ア 5 ルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ビフ ェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキ ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ 10 基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルス ルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホ ニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を 有する置換複素環基又は $-A^7-R^9$ 〔式中、 A^7 は-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2-$ 、 $-N(R^{10})-$ (式中、 R^{10} は水素原子、 C_1-C_6 アルキルカル ボニル基、ハロ C₁-C₆アルキルカルボニル基、 C₁-C₆アルコキシカルボニル 15 基、 C₁-C₆アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ C₁-C₆ アルキルアミノカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、 ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキ シ基、ハロ C₁-C₆アルコキシ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキ ルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニ 20 ル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基か ら選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、フェニル C₁ -C₄アルコキシカルボニル基、同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、 C₁-C₆アルコキシ基、ハロ C₁-25 C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 ア ルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以 上の置換基を環上に有する置換フェニル C₁-C₄アルコキシカルボニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基を示す。)、-

- 10 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル C_1 - C_4 アルキル基、同一又 は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、
- 15 ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1 - C_4 アルキル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、

 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 -20 C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカーニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示し、

(2) A^7 が-SO-、 $-SO_2-$ 、-C (=O) -又は-C (=NOR 2)- (式 25 中、 R^2 は前記に同じ。)を示す場合、 R^9 は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、 $\cap C_1-C_6$ アルキル基、 C_3-C_6 アルケニル基、 $\cap C_3-C_6$ アルケニル基、 $\cap C_3-C_6$ アルケニル基、 $\cap C_3-C_6$ シクロアルキル基、 $\cap C_3-C_6$ シクロアルキル基、 $\cap C_3-C_6$ シクロアルキル基、 $\cap C_3-C_6$ シクロアルキル基、 $\cap C_3-C_6$ アルキルアミノ基、 $\cap C_1$ (表 アルキルアミノ基、 $\cap C_1$ (表 アルキルアミノ基、 $\cap C_1$ (本 2) 本のでも良く、

ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキ シ基、ハロ C₁-C₆アルコキシ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキ ルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニ ル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基か 5 ら選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ基、同一 又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキ ル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ 基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁- C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 ア 10 ルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル アミノ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆ アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、 C₁-C₆アルコキシ基、ハロ C₁-C₆アル コキシ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アル キルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキル スルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置 換基を有する置換複素環基を示す。〕を示し、ℓは1~4の整数を示す。)を示 し、R⁸は前記に同じくし、pは、

- (1) QがQ1を示す場合、 $1\sim4$ の整数を示し、R7 はヘテロ環上の隣り合った炭素原子と一緒になって、 $1\sim3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄 原子又は窒素原子により中断されても良い $5\sim7$ 員環を形成することもでき、更に、R7 は結合しているヘテロ環の同一炭素原子と一緒になって $1\sim3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $3\sim7$ 員環を形成することもできる。
- (2) QがQ 2 を示す場合、 $1\sim6$ の整数を示し、R 7 はヘテロ環上の隣り合っ た炭素原子と一緒になって、 $1\sim3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $5\sim7$ 員環を形成することもでき、更に、R 7 は結合しているヘテロ環の炭素原子と一緒になって $1\sim3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $3\sim7$ 員環を形成することもできる。

- (3) $QがQ^3$ を示す場合、 $1\sim 2$ の整数を示し、 R^7 はヘテロ環上の隣り合った炭素原子と結合して、 $1\sim 3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $5\sim 7$ 員環を形成することもできる。
- (4) QがQ⁴ を示す場合、1~2の整数を示す。) を示す。}
- 5 で表されるベンズアミド誘導体及び該化合物を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

発明を実施するための形態

本発明のベンズアミド誘導体の一般式(I) の定義において「ハロゲン原子」と は塩素原子、臭素原子、沃素原子、フッ素原子を示し、「n-」とはノルマルを、 「i-」とはイソを、「s-」とはセカンダリーを、「t-」とはターシャリー 10 を示し、「 C_1 - C_6 アルキル」とは、例えばメチル、エチル、n-プロピル、iープロピル、nーブチル、iーブチル、sーブチル、tーブチル、nーペンチル、 ネオペンチル、n-ヘキシル等の直鎖又は分枝状の炭素原子数1から6個のアル キル基を示し、「ハロ C₁-C₆アルキル」とは、同一又は異なっても良い1以上 15 のハロゲン原子により置換された直鎖又は分枝状の炭素原子数1から6個のアル キル基を示し、例えば、トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、パーフル オロエチル基、パーフルオロイソプロピル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、 1-ブロモエチル基、2,3-ジブロモプロピル基を示し、「C₁-C₈アルキレ ン」はメチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、ジメチルメチレン、テ 20 トラメチレン、イソブチレン、ジメチルエチレン、オクタメチレン等の直鎖又は 分枝状の炭素原子数 1 から 8 個のアルキレン基を示す。「複素環基」とは、例え ばピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、フリル基、テトラ ヒドロフリル基、チエニル基、テトラヒドロチエニル基、テトラヒドロピラニル 基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、 25 イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピラ

5 イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピラ ゾリル基等の複素環基を示し、「縮合環」とは、例えばナフタレン、テトラヒド ロナフタレン、インデン、インダン、キノリン、キナゾリン、クロマン、イソク ロマン、インドール、インドリン、ベンゾジオキサン、ベングジオキソール、ベ ンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、ベンゾチオフェン、ジヒドロベンゾチオフ ェン、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンズイミダゾール、インダゾール等の縮合環を示す。

本発明の一般式(I) で表されるベンズアミド誘導体は、その構造式中に不斉炭素原子又は不斉中心を含む場合があり、光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあるが、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式(I) 表されるベンズアミド誘導体は、その構造式中に炭素 – 炭素二重結合又は炭素 – 窒素二重結合を含む場合があり、幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

- 本発明の一般式(I) 表されるベンズアミド誘導体において、好ましい化合物としては、 Z^1 が酸素原子を示し、Rが水素原子又はメチル基で示し、Xが同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基又はハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基を示し、Xの置換位置としては、芳香環置換カルバモイル基が結合した位置に対して3位又は4位であり、
- ルチオ C_1 - C_8 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル C_1 - C_8 アルキル基又 25 は C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_8 アルキル基を示し、R 7 の置換数 p が 1 又 は 2 を示す化合物群が挙げられる。

更に好ましい化合物群としては、 Z^1 が酸素原子を示し、Rが水素原子を示し、Xがハロゲン原子を示し、Xの置換位置としては、芳香環置換カルバモイル基が結合した位置に対して3位であり、 B^1 、 B^2 、 B^3 及び B^4 が共に炭素原子を

示し、Yが同一又は異なっても良く、塩素原子、メチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオローiープロピル基、トリフルオロメトキシ基又は1ートリフルオロメチルー2,2,2ートリフルオロエトキシ基を示し、Yの置換位置及び置換数mとしては、アミド基が結合した位置に対して2,4位のジ置換であり、QがQ¹を示し、Wは酸素原子を示し、R⁷は同一又は異なっても良く、メチル基、エチル基、iープロピル基、tーブチル基、メチルチオメチル基、メチルスルフィニルメチル基、メチルスルホニルメチル基、エチルチオメチル基、エチルスルフィニルメチル基、メチルスルホニルメチル基、エチルチオメチル基、エチルスルフィニルメチル基又はエチルスルホニルメチル基を示し、R⁷の置換数pが1又は2を示す10 化合物群が挙げられる。

本発明の一般式(I-1) で表されるベンズアミド誘導体は、例えば下記に図示する製造方法にて製造することができる。

製造方法1

20

(式中、B¹、B²、B³、B⁴、X、Y、Q、n及びmは前記に同じ。)

一般式(III) で表される安息香酸誘導体と一般式(IV)で表される芳香環アミン類とを不活性溶媒の存在下に縮合剤等を用いて反応させることにより、一般式(I-1) で表されるベンズアミド誘導体を製造することができる。

本反応で使用できる縮合剤としては、例えばシアノリン酸ジエチル (DEPC)、カルボニルジイミダゾール (CDI)、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、クロロ炭酸エステル類、ヨウ化2-クロロ-1-メチルピリジニウム等が例示できる。

本反応で使用できる塩基としては、無機塩基又は有機塩基が挙げられ、無機塩

基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属原子の水酸化物や水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属の水素化物、カリウム t ーブトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルコールのアルカリ金属塩、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム等の炭酸塩類、有機塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン、DBU等を例示することができ、本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の塩素化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド、1、3ージメチルー2ーイミダゾリジノン、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類等の不活性溶媒を例示することができる。

15 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれ かの反応剤を過剰に使用することもできる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応 時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適 宜選択すれば良い。

20 反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

一般式(III) で表される安息香酸誘導体は、Tetrahedron, 44, 1631 (1988)、Chem. Rev., 90, 879, (1990)等に 25 記載の方法に従って製造することができる。

製造方法2

(式中、 B^1 、 B^2 、 B^3 、 B^4 、X、Y、Q、n及びmは前記に同じくし、h a l はハロゲン原子を示す。)

一般式(III) で表される安息香酸誘導体を不活性溶媒の存在下又は不存在下に、 ハロゲン化剤等を用いることによりハロゲン化ベンゾイル誘導体(V) とし、次い 15 で一般式(IV)で表される芳香環アミン類と不活性溶媒の存在下、塩基等を用いて 反応させることにより、一般式(I-I) で表されるベンズアミド誘導体を製造する ことができる。

2-1. 一般式(III) →一般式(V)

本反応で使用できるハロゲン化剤として、例えば塩化チオニル、オキシ塩化リン、三塩化リン、三臭化リン、オキシ臭化リン、ジクロロメチルメチルエーテル等のハロゲン化剤を例示することができ、その使用量は一般式(III)で表される安息香酸誘導体に対し、1~100当量の範囲から適宜選択して使用すれば良い。本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の塩素化芳香族炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応

時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適 宜選択すれば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離、あるいは単離することなく次の反応に用いることができる。

5 2-2. 一般式(V) →一般式(I-1)

本反応で使用できる塩基としては、製造方法1で例示の塩基を使用することができ、不活性溶媒としては、製造方法1で例示の不活性溶媒を使用することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれ 10 かの反応剤を過剰に使用することもできる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適 宜選択すれば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応 15 じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造す ることができる。

製造方法3

$$20 \qquad \begin{array}{c} X_{1} \\ X_{1} \\ X_{1} \\ X_{1} \\ X_{2} \\ X_{3} \\ X_{1} \\ X_{1} \\ X_{1} \\ X_{1} \\ X_{2} \\ X_{3} \\ X_{1} \\ X_{2} \\ X_{3} \\ X_{1} \\ X_{1} \\ X_{1} \\ X_{2} \\ X_{3} \\ X_{2} \\ X_{3} \\ X_{3} \\ X_{4} \\ X_{1} \\ X_{1} \\ X_{1} \\ X_{2} \\ X_{3} \\ X_{4} \\ X_{5} \\ X_$$

(式中、R、R 7 、B 1 、B 2 、B 3 、B 4 、X、Y、Z 1 、n及びmは前記に 25 同じくし、Mはハロゲン原子又はR 12 SO $_3$ -(式中、R 12 はメチル基等の C_1 - C_6 アルキル基又はパラ位にメチル基等の置換基を有しても良いフェニル基を示す。)を示す。)

一般式(VI)で表されるフタル酸ジアミド誘導体と不活性溶媒の存在下又は不存在下に、ハロゲン化剤又はスルホン酸エステル化剤を用いて反応させることによ

り一般式(VII) とし、次いで加熱条件又は塩基等を使用することにより、一般式 (I-2) で表されるベンズアミド誘導体を製造することができる。

3-1. 一般式(VI)→一般式(VII)

本反応で使用できるハロゲン化剤としてジエチルアミノ硫黄トリフルオリド (DAST)、塩化チオニル、オキシ塩化リンあるいはトリフェニルホスフィン と四臭化炭素又は四塩化炭素等の組み合わせが例示できる。本反応で使用できる スルホン酸エステル化剤としてメタンスルホニルクロリド、p-トルエンスルホニルクロリド等のスルホン酸ハロゲン化物等が例示できる。

本反応で使用できる塩基としては、製造方法1で例示の塩基を使用することが 10 でき、不活性溶媒としては、製造方法1で例示の不活性溶媒の他に、ピリジン等 の不活性溶媒を使用することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上 混合して使用することができる。

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれ かの反応剤を過剰に使用することもできる。

- 15 反応温度は-20℃乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、 反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲 で適宜選択すれば良い。
 - 一般式(VII) で表されるフタル酸ジアミド誘導体の内、Mが R^{12} SO_3 を示す化合物群は、新規な誘導体であり、殺虫活性を示すものである。
- 20 一般式(VI)で表されるフタル酸ジアミド誘導体は、特開平11-240857 号公報記載の方法に従って製造することができる。

3-2. 一般式(VII) →一般式(I-2)

本反応で使用できる塩基及び不活性溶媒は、例えば製造方法1に記載の塩基及 び不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上 25 混合して使用することができる。

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれ かの反応剤を過剰に使用することもできる。

反応温度は-20℃から用いる不活性溶媒の沸点までの温度下で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが数分乃至48時間の範

囲で適宜選択すれば良い。

製造方法4

5
$$X_{0}$$
 $R^{7}p$ $R^{7}p$

10

(式中、R、R 7 、B 1 、B 2 、B 3 、B 4 、X、Y、Z 1 、n及びmは前記に同じ。)

一般式(VI)で表されるフタル酸ジアミド誘導体とイオウ化剤とを不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(I-3)で表されるベンズアミド誘導体を15 製造することができる。

本反応で使用できるイオウ化剤としては、例えば五硫化二リン等が例示でき、 その使用量は一般式(VI)で表されるフタル酸ジアミド誘導体に対し、1~5当量 の範囲から適宜選択して使用すればよい。

本反応で使用できる不活性溶媒としては、例えば製造方法1に記載の不活性溶 20 媒の他に、水等も使用することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以 上混合して使用することができる。反応温度は室温乃至用いる不活性溶媒の沸点 までの温度下で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等により一定し ないが数分乃至48時間の範囲で適宜選択すれば良い。

製造方法5

(式中、R、R 7 、B 1 、B 2 、B 3 、B 4 、X、Y、Z 1 、n及びmは前記に 10 同じ。)

一般式(I-2) で表されるベンズアミド誘導体を、不活性溶媒の存在下に、触媒等を用いて反応させることにより一般式(I-4) で表されるベンズアミド誘導体を製造することができる。

本反応で使用できる触媒としては例えば酸化ニッケル等が例示でき、その使用 15 量は一般式(I-2) で表されるベンズアミド誘導体に対し、1~20当量の範囲から適宜選択して使用すればよい。

本反応で使用できる不活性溶媒としては、例えば製造方法1で例示の不活性溶媒を使用することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

20 反応温度は室温乃至用いる不活性溶媒の沸点までの温度下で行うことができ、 反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが数分乃至48時間の範囲で 適宜選択すれば良い。

以下に一般式(I) で表されるベンズアミド誘導体の代表的な化合物を第1表~ 第4表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

25 尚、表中、「Me」はメチルを、「Et」はエチルを、「Pr」はプロピルを、 「Bu」はブチルを、「Ph」はフェニルを、「Bn」はベンジルを、「c-」は脂環式基を、 (R) 及び (S) は当該置換位置での立体異性を示す。

一般式(I-5):

第1表 R=H、 $Z^1=O$ (但し、 Z^1 は特記した化合物を除く。)

_							
	No.	Xn	Q	W	R^7_p	·Ym Ā	烛点 (℃)
-	1- 1	Н	Q ¹	0	4-(4-t-Bu-Ph)	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	73-74
	1- 2	Н	Q^1	0	4,4-(Me) ₂	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	115-116
5	1- 3	Н	Q^1	0	4-Bn	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	42-43
	1- 4	6-Cl	Q^1	0	4,4-(Me) $_2$	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	166-167
	1- 5	6-C1	Q^{1}	0	4-Et	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	107-109
	1- 6	6-C1	Q^1	0	4,4-(Me) ₂	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	58
	1- 7	6-C1	Q^1	0	4-Me(R)	$2\hbox{-Me-4-CF}_2\hbox{CF}_3$	123
10	1- 8	6-C1	Q^1	0	4-Me(S)	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	123
	1- 9	6-C1	Q^1	0	4- (4-Ph-Ph)	$\hbox{2-Me-4-CF}_2\hbox{CF}_3$	188
	1-10	6-C1	Q^1	0	4-Ph	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	66-67
	1-11	3-C1	Q^1	0	4-(4-t-Bu-Ph)	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	189-190
	1-12	3-C1	Q^1	0	4-(4 - Ph-Ph)	$2\hbox{-Me-}4\hbox{-CF}_2\hbox{CF}_3$	201-202
15	1-13	3-C1	Q^1	0	4-Me(R)	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	136
	1-14	3-C1	Q^1	0	4-Me(S)	$2\text{-Me-4-CF}_2\text{CF}_3$	136
	1-15	3-C1	Q^1	0	4-Ph	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	119-121
	1-16	3-C1	Q^1	0	4,4-(Me) ₂	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	164-165
	1-17	3-C1	Q^1	0	4,4-(Me) ₂	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)$	2 191-193
20	1-18	3-C1	Q^1	0	5-Ph	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	206
	1-19	6-I	Q^1	0	4-Me(R)	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	103-104
	1-20	3-I	Q^1	0	4,4-(Me) $_2$	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_3$	173
	1-21	3-I	Q^1	0	4-Me(R)	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}_2 ext{CF}_3$	123-124
	1-22	3-I	Q^1	0	4-Me(S)	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	122-123
25	1-23	3-I	Q ¹	0	4,4-(Me) ₂	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}_2 ext{CF}_3$	192-193

笙	1	表	(続き)	١
777	1	4X	(N)LC	,

	No.	Xn	Q	W	R ⁷ p	Ym	融点 (℃)
	1-24	3-I	Q ¹	0	4,4-(Me) ₂	2-Et-4-CF ₂ CF ₃	
5	1-25	3-I	Q^{1}	0	4,4-(Me) ₂	2-F-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-26	3-1	Q^1	0	4,4-(Me) ₂	2 -C1- 4 -CF $_2$ CF $_3$	
	1-27	3-I	Q^1	0	4,4-(Me) ₂	2-Me-3-F-4-CF(C	CF ₃) ₂
	1-28	3-I	Q^{1}	0	4,4-(Me) ₂	2 –F– 4 –CF $_2$ CF $_3$	
	1-29	3-I	Q^1	0	4,4-(Me) ₂	2-Me-5-F-4-CF(C	CF ₃) ₂
10	1-30	3-I	Q^1	0	4,4-(Me) ₂	2 -Et- 4 -CF(CF $_3$)	2
	1-31	3-I	Q^1	0	4,4-(Me) $_2$	2-C1-4-CF(CF ₃)	2
	1-32	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SMe	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}_2 ext{CF}_3$	
	1-33	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SMe	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)$	2
	1-34	3-I	Q^{1}	0	4-CH ₂ SMe	2-Me-4-0CF ₃	
15	1-35	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SMe	2-Me-4-SCF ₃	
	1-36	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SMe	2 -Et- 4 -CF $_2$ CF $_3$	
	1-37	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SMe	2-F-4-CF(CF ₃) ₂	2
	1-38	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SMe	2-C1-4-CF ₂ CF ₃	
	1-39	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SMe	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂
20	1-40	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SOMe	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}_2 ext{CF}_3$	
	1-41	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SOMe	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)$	2
	1-42	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SOMe	2-Me-4-OCF ₃	
	1-43	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SOMe	$2\text{-Me-}4\text{-SCF}_3$	
	1-44	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SOMe	2-Et-4-CF ₂ CF ₃	
25	1-45	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SOMe	2-F-4-CF(CF ₃)	2
	1-46	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SOMe	2-C1-4-CF ₂ CF ₃	

第1表 (続き)

							
	No.	Xn	Q	W	R ⁷ p	Ym	融点 (℃)
	1-47	3-1	Q ¹	0	4-CH ₂ SOMe	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃)	2
	1-48	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SO ₂ Me	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	
5	1-49	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SO ₂ Me	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
	1-50	3-I	Q^1	0	4 -CH $_2$ SO $_2$ Me	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_3$	
	1-51	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SO ₂ Me	2-Me-4-SCF ₃	
	1-52	3-I	Q^1	0	4 -CH $_2$ SO $_2$ Me	2 -Et- 4 -CF $_2$ CF $_3$	
	1-53	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ SO ₂ Me	$2\text{-F-4-CF(CF}_3)_2$	
10	1-54	3-I	Q^1	0	4 -CH $_2$ SO $_2$ Me	2-C1-4-CF ₂ CF ₃	
	1-55	3-I	Q^1	0	4 -CH $_2$ SO $_2$ Me	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃)	2
	1-56	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SMe	$2\text{-Me-4-CF}_2\text{CF}_3$	
	1-57	3-I	Q^1	0	4 -Me- 4 -CH $_2$ SMe	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	163-164
	1-58	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SMe	2-Me-4-OCF ₃	
15	1-59	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SMe	2-Me-4-SCF_3	
	1-60	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SMe	$2\text{-Et-4-CF}_2\text{CF}_3$	
	1-61	3-I	Q^{1}	0	4-Me-4-CH ₂ SMe	2 -F- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
	1-62	3-I	Q^1	0	$4\text{-Me-}4\text{-CH}_2\text{SMe}$	2 -Cl-4-CF $_2$ CF $_3$	
	1-63	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SMe	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃)	2
20	1-64	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SOMe	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}_2 ext{CF}_3$	
	1-65	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SOMe	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	80-82
	1-66	3-I	Q^{1}	0	4-Me-4-CH ₂ SOMe	2-Me-4-OCF ₃	
	1-67	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SOMe	2-Me-4-SCF ₃	
	1-68	3-1	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SOMe	2-Et-4-CF ₂ CF ₃	
25	1-69	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SOMe	2-F-4-CF(CF ₃) ₂	

第1表 (続き)

No.	Хn	Q	W	R ⁷ _p	Ym	融点 (℃)
1-70	3-I	Q ¹	0	4-Me-4-CH ₂ SOMe	2-C1-4-CF ₂ CF ₃	
1-71	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SOMe	2-Me-3-F-4-CF(C	F ₃) ₂
1-72	3-I	Q^1	0	$4\text{-Me-}4\text{-CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-73	3-I	Q^1	0	$4\text{-Me-}4\text{-CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	108-110
1-74	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SO ₂ Me	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_3$	
1-75	3-I	Q^1	0	$4\text{-Me-}4\text{-CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	$2\text{-Me-}4\text{-SCF}_3$	
1-76	3-1	Q^1	0	4 -Me- 4 -CH $_2$ SO $_2$ Me	$2\text{-Et-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	
1-77	3-I	Q^1	0	$4\text{-Me-}4\text{-CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	2-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-78	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SO ₂ Me	2 -Cl-4-CF $_2$ CF $_3$	
1-79	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SO ₂ Me	2-Me-3-F-4-CF (CF	³) ₂
1-80	3-I	Q^1	0	$4\text{-Me-}4\text{-CH}_{2}\mathrm{SO}_{2}\mathrm{Me}$	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}_2 ext{CF}_3$	
1-81	3-I	Q^1	0	4-(CH ₂) ₄ -4	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	187-188
1-82	3-I	Q^1	0	4,4-(Me) ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	171-17
1-83	6-C1	Q^1	0	Н	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	
1-84	3-C1	Q^1	S	4-Me	$2 ext{-Me} ext{-}4 ext{-}CF_2CF_3$	140-144
1-85	3-C1	Q^1	S	4,4-(Me) ₂	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	152-15
1-86	3-I	Q^1	S	4,4-(Me) ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	135-13
1-87	3-I	Q^1	NMe	4-CH ₂ SMe	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-88	3-I	Q^1	S	4-CH ₂ SMe	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	$(Z^1 = S)$
1-89	3-I	Q^1	NMe	4-CH ₂ SMe	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	$(Z^1 = S)$
1-90	3-I	Q^1	0	$4\text{-Me-}4\text{-CH}_{2}\operatorname{SEt}$	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	60-62
1-91	6-1	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SEt	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	52-55
1-92	3-I	Q^1	0	$4\text{-Me-}4\text{-CH}_{2}\text{SO}_{2}\text{Et}$	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	80-82
					·	

笙	1	表	(続き)
71.7		100	(MYLC)

No.	Χn	Q	W	R ⁷ p	Ym	融点 (℃)
1-93	3-I	Q ¹	0	4-Me-4-CH ₂ S- (4-t-Bu-Ph)	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	140-141

$$Q = 2 \sqrt[3]{\frac{4}{N}} + \frac{R^7 p}{5} \qquad \frac{3}{N} + \frac{4}{N} + \frac{3}{N} + \frac{2}{N} + \frac{1}{N} + \frac{1}{N}$$

第2表 R=H、 $Z^1=O$

10	No.	Xn	Q	₩	R ⁷ p	Ym	融点 (℃)
·	2- 1	3-I	Q ²	0	4-CH ₂ SMe	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	2- 2	3-I	Q^2	S	4-CH ₂ SMe	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	2- 3	3-I	Q^2	NMe	4 -CH $_2$ SMe	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
	3- 1	6-C1	Q^3	0	Н	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	197-200
15	3- 2	6-C1	Q^3	0	4-Me	$2-Me-4-CF(CF_3)_2$	187
	3- 3	3-C1	Q^3	0	4-Me	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}_2 ext{CF}_3$	
	3- 4	3-1	Q ³	0	4 -CH $_2$ SMe	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	3- 5	3-I	Q^3	S	4 -CH $_2$ SMe	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	3- 6	3-I	Q ³	NMe	4 -CH $_2$ SMe	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
20	4- 1	3-C1	Q^4	0	2-t-Bu	2-Me-4-OCF ₃	140
	4- 2	3-I	Q^4	0	2 -CH $_2$ SMe	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	4- 3	3-I	Q^4	S	2 -CH $_2$ SMe	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	4- 4	3-I	Q^4	NMe	2 -CH $_2$ SMe	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	4- 5	3-I	Q^4	0	2 -CH $_2$ SMe	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
25	4- 6	3-I	Q^4	S	2 -CH $_2$ SMe	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
	4- 7	3-I	Q ⁴	NMe	2-CH ₂ SMe	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

$$Q = \bigvee_{N=N}^{N=1} \bigcap_{N=1}^{N=1} \bigcap_{N=1}^{N$$

 $R = H \setminus Z^1$ 第3表 R⁷又はR⁸ Ym 融点(℃) No. Xn Q Q^5 10 5-1 H $2-Me-4-CF_2CF_3$ 0 t-Bu 135 Q^5 5-2 H 0 t-Bu 2-Me-4-OCF 3 115 Q^5 5- 3 3-C1 t-Bu 2-Me-4-OCF 3 100 Q^5 5- 4 3-I 0 CH 2 SMe 2-Me-4-CF(CF₃)₂ Q^5 5- 5 3-I S CH 2 SMe $2-Me-4-CF(CF_3)_2$ Q^5 5- 6 3-I 15 NMe CH₂SMe $2-Me-4-CF(CF_3)_2$ Q^6 6- 1 H 0 4-C1-Ph 2-Me 218-219 Q^6 6-2 H 2-Me-4-CF 2 CF 3 4-C1-Ph 141-148 Q^6 6-3 H i-Pr 2-Me 159-165 Q^6 6-4 H i-Pr 2-Me-4-C1 300< Q^6 20 6-5 H 0 i-Pr 2-Me-4-OCF₃ 159 Q^6 6- 6 3-I CH₂SMe $2-Me-4-CF(CF_3)_2$ 6- 7 3-I Q^6 CH_2SMe $2-Me-4-CF(CF_3)_2$ 6-8 3-I Q^6 CH₂SMe NMe $2-Me-4-CF(CF_3)_2$ Q^7 7- 1 3-I Ме 2-Me-4-CF(CF₃)₂ Q^8 25 8- 1 3-I Мe $2-Me-4-CF(CF_3)_2$

一般式(I-6):

第4表 R=H、 $Z^1=O$

10	No.	Xn	Q W	R	⁷ p 又はR ⁸	Ym	融点 (℃)
	9- 1	3-F	Q ¹	0	4-CH ₂ SMe	6-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	9- 2	3-I	Q^1	0	4,4-(Me) ₂	6-Me-4-OCH(CF ₃)	2 204-205
	9- 3	3-C1	Q^1	0	2-Me	$4 ext{-Me-}2 ext{-CF}_2 ext{CH}_3$	
	9- 4	3-I	Q^1	S	4,4-(Me) $_2$	6 -C1-2-OCHF $_2$	
15	9- 5	3-I	Q^1	0	4-Me-4-CH ₂ SMe	$4 ext{-Me-}2 ext{-CF(CF}_3)_2$	
	9- 6	$3-N0_2$	Q^1	0	4,4-(Me) $_2$	6 -MeO-2-CF(CF $_3$)	2
	9- 7	3-Br	Q^1	0	4-Cl-Ph	6-C1-2-CF(CF ₃) ₂	
	9- 8	3-I	Q^1	0	4, 4-(Me) $_2$	6-Me-2-OCF ₂ CF ₂ H	I
	9- 9	3-I	Q^1	0	4-CH ₂ OMe	6-Me-2-OCF ₂ CHFO	CF ₃
20	9-10	3-C1	Q^3	0	4-t-Bu	6-Me-2-OCF ₂ CF ₂ C	F ₃
	9-11	3-C1	Q^4	0	2-i-Pr	4 -Me-2-OCF $_2$ Br	
	9-12	3-I	Q^5	0	CH ₂ SMe	4-Me-2-OCF ₂ CF ₂ C	F ₃
	9-13	3-I	Q^6	0	CH ₂ SMe	$6 ext{-Me} ext{-}4 ext{-}CF_2CF_3$	
	9-14	3-I	Q^6	NMe	CH ₂ SMe	6-C1-2-CF(CF ₃) ₂	
25	9-15	3-1	Q^7	-	Me	2-CF(CF ₃) ₂	

**		114 1
第	4表	(続き)

No.	Xn	Q	W	R ⁷ p	又はR ⁸	Ym	点蛹	(°C)
9-16	3-I	Q ⁸	_		Me	2-OCH(CF ₃) ₂		

- 本発明の一般式(I) で表されるベンズアミド誘導体を有効成分として含有する 農園芸用殺虫剤は水稲、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等を加害する各種農 林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えばリ ンゴコカクモンハマキ (Adoxophyes orana fasciata)、チャノコカクモンハマ キ (Adoxophyes sp.)、リンゴコシンクイ (Grapholita inopinata)、ナシヒメ
- 10 シンクイ (Grapholita molesta) 、マメシンクイガ (Leguminivora glycinivorella) 、クワハマキ (Olethreutes mori) チャノホソガ (Caloptilia thevivora) 、リンゴホソガ (Caloptilia zachrysa) 、キンモン ホソガ (Phyllonorycter ringoniella) 、ナシホソガ (Spulerrina astaurota) 、モンシロチョウ (Piers rapae crucivora) 、オオタバコガ類 (Heliothis
- 15 sp.)、コドリンガ (Laspey resia pomonella)、コナガ (Plutella xylostella)、リンゴヒメシンクイ (Argyresthia conjugella)、モモシンクイガ (Carposina niponensis)、ニカメイガ (Chilo suppressalis)、コブノメイガ (Cnaphalocrocis medinalis)、チャマダラメイガ (Ephestia elutella)、クワノメイガ (Glyphodes pyloalis)、サンカメイガ (Scirpophaga

オンシツコナジラミ (Trialeurodes vaporariorum)、ニセダイコンアブラムシ (Lipaphis erysimi) 、モモアカアブラムシ (Myzus persicae) 、ツノロウムシ (Ceroplastes ceriferus)、ミカンワタカイガラムシ (Pulvinaria aurantii) 、ミカンマルカイガラムシ(Pseudaonidia duplex) 、ナシマルカ 5 イガラムシ (Comstockaspis perniciosa) 、ヤノネカイガラムシ (Unaspis yanonensis) 等の半翅目害虫、ネグサレセンチュウ (Pratylenchus sp.) 、ヒメ コガネ (Anomala rufocuprea) 、マメコガネ (Popillia japonica) 、タバコシ バンムシ(Lasioderma serricorne)、ヒラタキクイムシ(Lyctus brunneus)、 ニジュウヤホシテントウ (Epilachna vigintiotopunctata)、アズキゾウムシ (Callosobruchus chinensis)、ヤサイゾウムシ (Listroderes costirostris)、 10 コクゾウムシ(Sitophilus zeamais)、ワタミゾウムシ(Anthonomus gradis gradis)、イネミズゾウムシ(Lissorhoptrus oryzophilus)、ウリハムシ (Aulacophora femoralis)、イネドロオイムシ (Oulema oryzae)、キスジノ ミハムシ (Phyllotreta striolata)、マツノキクイムシ (Tomicus piniperda)、コロラドポテトビートル (Leptinotarsa decemlineata)、メキ シカンビーンビートル (Epilachna varivestis)、コーンルートワーム類 (Diabrotica sp.) 等の甲虫目害虫、ウリミバエ (Dacus (Zeugodacus) cucurbitae) 、ミカンコミバエ (Dacus (Bactrocera) dorsalis) 、イネハモグリ バエ(Agromyza oryzae)、タマネギバエ(Delia antiqua)、タネバエ (Delia platura)、ダイズサヤタマバエ (Asphondylia sp.)、イエバエ 20 (Musca domestica)、アカイエカ (Culex pipiens pipiens) 等の双翅目害虫、 ミナミネグサレセンチュウ (Pratylenchus coffeae) 、ジャガイモシストセンチ ュウ(Globodera rostochiensis)、ネコブセンチュウ(Meloidogyne sp.)、 ミカンネセンチュウ (Tylenchulus semipenetrans)、ニセネグサレセンチュウ (Aphelenchus avenae)、ハガレセンチュウ (Aphelenchoides ritzemabosi) 等 25 のハリセンチュウ目害虫等に対して強い殺虫効果を有するものである。 本発明の一般式(I) で表されるベンズアミド誘導体を有効成分とする農園芸用 殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与

える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するものであるので、害虫の発生が予

測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水田、畑、 果樹、野菜、その他の作物、花卉等の水田水、茎葉又は土壌に処理することによ り本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。

本発明の農園芸用殺虫剤は、農薬製剤上の常法に従い、使用上都合の良い形状 5 に製剤して使用するのが一般的である。

即ち、一般式(I) で表されるベンズアミド誘導体はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させ、適宜の剤形、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、粒剤、粉剤、錠剤等に製剤して使用すれば良い。

- 10 本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、 固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、 鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、 粉砕合成樹脂等の合成重合体、粘土類(例えばカオリン、ベントナイト、酸性白 土等)、タルク類(例えばタルク、ピロフィライド等)、シリカ類(例えば珪藻 15 土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン〔含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成 高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。〕)、 活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉砕物、フライアッシュ、砂、 炭酸カルシウム、燐酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、硫安、燐安、硝安、尿素、 塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以 20 上の混合物の形で使用される。
- 液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうることとなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類(例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等)、ケトン類(例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等)、エーテル類(例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等)、脂肪族炭化水素類(例えばケロシン、鉱油等)、芳香族炭化水素類(例

えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等)、ハロゲン化炭化水素類(例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等)、エステル類(例えば酢酸エチル、ジイソプピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等)、アミド類(例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等)、ニトリル類(例えばアセトニトリル等)、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用 10 し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び/又は湿潤の目的のために界面活性 剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレ ンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオ キシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、

15 ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、 ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エス テル等の界面活性剤を例示することができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び/又は結合の目的のために、次に 例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチ ルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

消泡剤としては、例えばシリコーン油等の補助剤を使用することもできる。

有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、例えば粉剤或いは粒剤とする場合は0.01から50重量%、又乳剤或いは水和剤とする場合

も同様0.01から50重量%が適当である。

本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適 宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除にに有効な量を当該害虫の発生が予 測される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。

5 本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.1gから10kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の農園芸用殺虫剤は、更に防除対象病害虫、防除適期の拡大のため、或 10 いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用病虫害防除剤と混合して使用することも可能である。

以下に本発明の代表的な実施例を例示するが、本発明はこれら実施例に限定されるものではない。

実施例1.3-ヨード-2-(4,4-ジメチルオキサゾリン-2-イル)-15 2'-メチル-4'-ヘプタフルオロイソプロピルベンズアニリド(化合物番号1-82)の製造

 $3-3-k-N^1-(2-k+n-4-n)$ クロール クロール クロール クロール $-N^2-(2-k+n+2-1, 1-k+2+n)$ ーフタル酸ジアミド 823mg (1. 44ミリモル) をピリジンに溶解し、メタンスルホニルクロリ

20 ド200mg (1.75ミリモル)を加え、室温で8時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、酢酸エチルで希釈後、水で洗浄した。芒硝で乾燥後減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサンー酢酸エチル=2:1)にて分離精製し、目的物400mg(収率:50%)を白色結晶として得た。

実施例2. 3-クロロー2- (4, 4-ジメチルチアゾリン-2-イル) -2'

25 -メチル-4' -ヘプタフルオロイソプロピルベンズアニリド (化合物番号1-85) の製造

 $3-\rho$ ロロー N^1 - (2-メチルー4- 2 クフルオロイソプロピルフェニル) - N^2 - (2-ヒドロキシー1, 1-ジメチルエチル) - 2 クのmg (1. 13ミリモル) をトルエンに溶解し、五硫化二リン500mg

(2.2ミリモル)を加え、60℃で2時間撹拌した。放冷後、30%水酸化ナトリウム水溶液を加え、30分間撹拌し、有機層を抽出後、希塩酸、水で洗浄した。芒硝で乾燥後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン-酢酸エチル=2:1)にて分離精製し、目的物23mg(収率:45%)を白色結晶として得た。

実施例3. 2-クロロー6- (オキサゾール-2-イル) -2' -メチル-4' -ヘプタフルオロイソプロピルベンズアニリド (化合物番号3-1) の製造

2-クロロー6- (オキサゾリン-2 -イル) -2' -メチルー4' -ヘプタ

フルオロイソプロピルベンズアニリド200mg (0.41ミリモル)をフルオ 10 ロベンゼンに溶解し、酸化ニッケル1gの存在下、8時間加熱還流した。放冷後、 ろ過により触媒を除去し、濾液を減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラ ムクロマトグラフィー (ヘキサンー酢酸エチル=1:1)にて分離精製し、目的 物61mg (収率:31%)を白色結晶として得た。

実施例4. 2-(2-t-ブチルオキサゾール-4-イル)-3-クロロ-2'15 -メチル-4'-トリフルオロメトキシベンズアニリド(化合物番号4-1)の製造

2- (2-t-ブチルオキサゾール-4-イル) -3-クロロ安息香酸 0.4 gをテトラヒドロフラン 3 0 m l に溶解し、2-メチル-4-トリフルオロメトキシアニリン 0.3 gとDEPC 0.4 g及びトリエチルアミン 0.3 gを加えて、撹拌下に3時間加熱還流を行った。反応終了後、反応液を水に注ぎ目的物を酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去し得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することにより目的物 0.18g(収率:28%)を得た。

実施例5. 2- (5-t-ブチルオキサジアゾール-3-イル) -3-クロロー 25 2'-メチル-4'-トリフルオロメトキシベンズアニリド (化合物番号5-3) の製造

2- (5-t-ブチルオキサジアゾール-3-イル) -3-クロロ安息香酸クロリド 0.5 gをテトラヒドロフラン30mlに溶解し、2-メチル-4-トリフルオロメトキシアニリン0.3 g及びトリエチルアミン0.2 gを加えて撹拌

下に1時間反応を行った。反応終了後、反応液を水中に注ぎ目的物を酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することにより目的物0.22g(収率:29%)を得た。

5 次に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、処方例中、部とあるのは重量部を示す。

製剤例1. 第1表~第4表記載の化合物 50部 10 キシレン 40部 ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物 10部 以上を均一に混合溶解して乳剤とする。 製剤例2. 第1表~第4表記載の化合物 3部 15 クレー粉末 8 2 部 珪藻土粉末 15部 以上を均一に混合粉砕して粉剤とする。 製剤例3. 20 第1表~第4表記載の化合物 5部 ベントナイトとクレーの混合粉末 9 0 部 5部 リグニンスルホン酸カルシウム

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。 製剤例4.

第1表~第4表記載の化合物 20部 カオリンと合成高分散珪酸 75部 ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルとアルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物 5部 以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

試験例1. コナガ (Plutella xylostella) に対する殺虫試験

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を第1表~第4表記載の化合物を有効成分とする薬剤を500pmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室に静置した。 薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準に従って判定を行った。1区10頭3連制

判定基準. A・・・死虫率100%

B···死虫率99%~90%

C···死虫率89%~80%

15 D・・・死虫率79%~50%

上記試験の結果、A以上の活性を示した化合物は1-6、1-7、1-8、1-10、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-21、1-22、1-57、1-65、1-73、1-82、1-86、1-90、1-91、1-92、3-1、3-2、4-1、5-1、5-2

20 及び9-2であった。

試験例2.ハスモンヨトウ(Spodoptera litura)に対する殺虫試験

第1表~第4表記載の化合物を有効成分とする薬剤を500ppmに希釈した 薬液にキャベツ葉片(品種:四季穫)を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9 cmのプラスチックシャーレに入れ、ハスモンヨトウ2令幼虫を接種した後、蓋 をして25℃の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、下記の式に より死虫率を算出し、判定基準は試験例1に従って行った。1区10頭3連制

無処理区生存虫数-処理区生存虫数

補正死虫率 (%) = ______ × 1 0 0 無処理区生存虫数 上記試験の結果、A以上の活性を示した化合物は1-13、1-14、1-16、1-17、1-20、1-21、1-22、1-23、1-57、1-73、1-82、1-85、1-86、1-90、1-92及び9-2であった。 試験例3、チャノコカクモンハマキ(Adoxophyes sp.)に対する殺虫試験

- 5 第1表~第4表記載の化合物を有効成分とする薬剤を500ppmに希釈した 薬液にチャ葉を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレ に入れ、チャノコカクモンハマキ幼虫を接種した後、25℃、湿度70%の恒温 室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、試験例1の判定基準に従って判 定を行った。1区10頭3連制
- 10 上記試験の結果、A以上の活性を示した化合物は1-1、1-2、1-6、1-10、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-20、1-21、1-22、1-23、1-57、1-65、1-73、1-82、1-85、1-86、1-90、1-91、1-92、3-2及び9-2であった。
- 15 以上のように、本発明の一般式(I) で表されるベンズアミド誘導体を有効成分 として含有する農園芸用殺虫剤は水稲、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等を 加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に顕著な 効果を示す。

請求の範囲

1. 一般式(I):

5

$$X_{0} \xrightarrow{X_{0}} B_{1} \xrightarrow{B_{1}^{2} B_{2}^{2}} Y_{0}$$

$$(I)$$

- 10 {式中、 Z^1 は酸素原子又は硫黄原子を示し、Rは水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基から選択される 1 以上の置換基で置換された C_1 - C_6 アルキル基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基を示す。
- 15 Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、同一又は異なっても良いトリ C_1 - C_6 アルキルシリル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルカナルチオ基、

 A^1 は-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2-$ 、-C (=O) -、-C ($=NOR^2$) - (式中、 R^2 は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 ア

ルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル C_1 - C_4 アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカースルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1 - C_4 アルキル基を示す。)、 C_1 - C_6 アルキレン基、ハロ C_1 - C_6 アルキレン基、 C_2 - C_6 アルケニレン基、ハロ C_2 - C_6 アルケニレン基、 C_2 - C_6 アルキニレン基

- (1) A^1 が-O-、-S-、-SO-又は $-SO_2-$ を示す場合、 R^1 はハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルケニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキル C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル 基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、
- 20 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル 基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^2$ - R^3 (式中、 A^2 は C_1 - C_6 アルキレン基、ハロ C_1 - C_6 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルキレン基、ハロ C_3 - C_6 アルケニレン基、
- 25 C_3 - C_6 アルキニレン基又はハロ C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、 R^3 は水素原子、ハロゲン原子、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、

 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 -C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基又は $-A^3-R^4$ (式中、 A^3 は-O-、 -S-、-SO-、 $-SO_2-$ 又は-C (=O) -を示し、 R^4 は C_1- C $_6$ アル 5 キル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、 C₃-C₆アルケニル基、ハロ C₃-C₆アルケニ ル基、 C₃-C₆シクロアルキル基、ハロ C₃-C₆シクロアルキル基、フェニル基、 同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキル チオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ 10 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、 複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、 ハロ C1-C6アルキル基、 C1-C6アルコキシ基、ハロ C1-C6アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフ 15 ィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル 基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有す る複素環基を示す。)を示す。)を示し、

(2) A^1 が-C (=O) -Zは-C ($=NOR^2$)- (式中、 R^2 は前記に同じ。)を示す場合、 R^1 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_2 - C_6 アルケニル基、ハロ C_2 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルカニン基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカンイニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又は C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基、 10000円のでは異なっても良く、 1000円ので、 100円ので、 100円ので、100

(3) A^1 が C_1-C_6 アルキレン基、ハロ C_1-C_6 アルキレン基、 C_2-C_6 アル ケニレン基、ハロ Co-C6アルケニレン基、 Co-C6アルキニレン基又はハロ C3 $-C_6$ アルキニレン基を示す場合、 R^1 は水素原子、ハロゲン原子、 C_3 - C_6 シク ロアルキル基、ハロ C₃-C₆シクロアルキル基、 C₁-C₆アルコキシカルボニル 15 基、同一又は異なっても良いトリ C₁-C₆アルキルシリル基、フェニル基、同一 又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキ ル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ 基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 ア 20 ルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複 素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル 基、ハロ C1-C6アルキルスルフィニル基、 C1-C6アルキルスルホニル基又は 25 ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換 複素環基又は $-A^4-R^5$ (式中、 A^4 は-O-、-S-、-SO-又は $-SO_9$ -を示し、 R^5 は C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアル キル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキ ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ WO 01/00599 PCT/JP00/04135

44

基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、

- 5 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^5$ - R^6 (式中、 A^5 は C_1 - C_6 アルキレン基、ハロ C_1 - C_6 アルキレン基、 C_2 - C_6 アルケニレン基、ハロ C_2 - C_6 アルキニレン基又はハロ C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、 C_6 は水素原子、ハロゲン原子、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 アルキル基、ハロ C_3 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオールエルフィニル基、
- 15 ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 -
- C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルカルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフ
- 25 ィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル 基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ

 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。)を示す。)を示す。〕を示す。

nは0~4の整数を示す。又、Xはフェニル環上の隣り合った炭素原子と一緒 10 になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハ ロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、 C₁-C₆アルコキシ 基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキル チオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル 基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基、フェ 15 ニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル 基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又は ハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 20 フェニル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁- C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 ア ルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 ア ルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキ ルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の 25 置換基を有する置換複素環基から選択される1以上の置換基を有することもでき る。

 B^1 、 B^2 、 B^3 及び B^4 は同一又は異なっても良く、窒素原子又は炭素原子を示し、Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン

WO 01/00599 PCT/JP00/04135

又、Yはフェニル環上の隣り合った炭素原子と一緒になって縮合環を形成する ことができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アル キル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキ 15 シ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキル スルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスル ホニル基、ハロ C1-C6アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なって も良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、 C₁-C₆ アルコキシ基、ハロ C₁-C₆アルコキシ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-20 C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルス ルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホ ニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基又は同 一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆ アルキル基、 C₁-C₆アルコキシ基、ハロ C₁-C₆アルコキシ基、 C₁-C₆アルキ 25 ルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハ ロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁ -C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基 から選択される1以上の置換基を有することもできる。

Qは $Q^1 \sim Q^8$ で表される以下のヘテロ環を示す。

10

(式中、Wは酸素原子、硫黄原子又は $-N(R^8)-($ 式中、 R^8 は $C_1 C_6$ アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_6 アルキル 基、ハロ C₁-C₆アルコキシ C₁-C₆アルキル基、 C₁-C₆アルキルチオ C₁-C₆ アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ C₁-C₆アルキル基、 C₁-C₆アルキルス 15 ルフィニル C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル C_1 - C_6 アル キル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル スルホニル C₁-C₆アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲ ン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ 20 基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択さ れる1以上の置換基を有する置換フェニル基、 C₁-C₆アルキルカルボニル基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミ 25 ノカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原 子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 -C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される

1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、フェニル C₁-C₄アルコキ シカルボニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アル キル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキ シ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキル 5 スルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスル ホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基 を環上に有する置換フェニル C₁-C₄アルコキシカルボニル基を示す。)を示す。 R^7 は $-(A^6)$ r-G, (式中、 A^6 は C_1 - C_8 アルキレン基、 C_3 - C_6 ア ルケニレン基又は C3-C6アルキニレン基を示し、rは0又は1の整数を示し、 10 Gは同一又は異なっても良く水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハ ロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル 基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アル コキシホスホリル基、同一又は異なっても良いジ C₁-C₆アルコキシチオホスホ リル基、ジフェニルホスフィノ基、ジフェニルホスホノ基、フェニル基、同一又 **15** は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル 基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1-C_6 アルキ ルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、ビフェ 20 ニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロC₁ $-C_6$ アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 ア ルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ビフ 25 ェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキ ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ 基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルス ルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホ ニル基又はハロ C1-C6アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を

WO 01/00599 PCT/JP00/04135

有する置換複素環基又は $A^7 - R^9$ 〔式中、 A^7 は A^7 と $-SO_2-$ 、 $-N(R^{10})-$ (式中、 R^{10} は水素原子、 C_1-C_6 アルキルカル ボニル基、ハロ C₁-C₆アルキルカルボニル基、 C₁-C₆アルコキシカルボニル 基、 C₁-C₆アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ C₁-C₆ 5 アルキルアミノカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、 ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキ シ基、ハロ C₁-C₆アルコキシ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキ ルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニ ル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基か 10 ら選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、フェニル С1 -C₄アルコキシカルボニル基、同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 -C₆アルコキシ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 C₁- C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 ア 15 ルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以 上の置換基を環上に有する置換フェニル C₁-C₄アルコキシカルボニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基を示す。)、- $C (= O) - 又は - C (= NOR^2) - (式中、R^2 は前記に同じ。)を示し、$ (1) $A^7 \dot{M} - O - \sqrt{-S} - \nabla \dot{U} - N (R^{10}) - (式中 \sqrt{R^{10}}) \dot{U}$ は前記に同じ。) 20 を示す場合、R⁹ は水素原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、 C₃-C₆アルケニル基、ハロ C₃-C₆アルケニル基、 C₃-C₆アルキニル基、ハロ C_3 - C_6 アルキニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル 基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、 C_1 -C₆アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン 25 原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、 C₁-C₆アルコキシ基、ハ ロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 -C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル C₁-C₄アルキル基、同一又

は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル 基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1 - C_4 アルキル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカフィニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示し、

(2) A^7 が-SO-、 $-SO_2-$ 、-C (=O) -又は-C (=NOR 2)- (式中、 R^2 は前記に同じ。)を示す場合、 R^9 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、

15 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ

ルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル

アミノ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆

アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アル

コキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。〕を示し、 ℓ は $1\sim 4$ の整数を示す。)を示 1 し、1 と 1 を 1 と 1

- (1) QがQ 1 を示す場合、 $1\sim 4$ の整数を示し、R 7 はヘテロ環上の隣り合った炭素原子と一緒になって、 $1\sim 3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $5\sim 7$ 員環を形成することもでき、更に、R 7 は結合しているヘテロ環の同一炭素原子と一緒になって $1\sim 3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $3\sim 7$ 員環を形成することもできる。
- (2) QがQ 2 を示す場合、 $1\sim6$ の整数を示し、R 7 はヘテロ環上の隣り合った炭素原子と一緒になって、 $1\sim3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $5\sim7$ 員環を形成することもでき、更に、R 7 は結合しているヘテロ環の炭素原子と一緒になって $1\sim3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $3\sim7$ 員環を形成することもできる。
- (3) QがQ 3 を示す場合、 $1\sim 2$ の整数を示し、R 7 はヘテロ環上の隣り合った炭素原子と結合して、 $1\sim 3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子 20 又は窒素原子により中断されても良い $5\sim 7$ 員環を形成することもできる。
 - (4) QがQ⁴ を示す場合、 $1 \sim 2$ の整数を示す。) を示す。} で表されるベンズアミド誘導体。

 $-C_6$ アルコキシハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 ア ルコキシ基、ハロ C₁-C₆アルコキシハロ C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆ アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基、同一又は異なっ ても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、 C₁-5 C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 -C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルス ルフィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基又はハロ C1-C6アルキルスルホニ ル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、同一又は異なって も良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 10 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 -C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルス ルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホ ニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基又は同一若しく は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル 15 基、 C₁-C₆アルコキシ基、ハロ C₁-C₆アルコキシ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキ ルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジルオキシ基を 示し、mが1~5の整数を示す。又、Yは芳香環上の隣り合った炭素原子と一緒 20 になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハ ロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ 基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキル チオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル 基、 C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から 25 選択される1以上の置換基を有することもでき、

QがQ¹、Q³、Q⁴YはQ⁵で表される以下のヘテロ環を示す、

WO 01/00599

(式中、Wは酸素原子、硫黄原子又は-N(R⁸)-(式中、R⁸はC₁- C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル 基、 C₁-C₆アルキルアミノカルボニル基又は同一若しくは異なっても良いジ 10 C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基を示す。)を示し、 R^7 はー(A^6) r -G, (式中、 A^6 は C_1 - C_8 アルキレン基を示し、rは0又は1の整数を示し、 Gは同一又は異なっても良く水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 C_3 - C_6 シク ロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル 基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、 15 ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフ ィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 C₁-C₆アルキルスルホニル 基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有す る置換フェニル基、ビフェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 20 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 ア ルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以 上の置換基を有する置換ビフェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハ 25 ロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆アルキル基、 C₁-C₆アルコキシ 基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキル チオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロ C₁-C₆アルキルスルフィニル 基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選 択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は-A 7 -R 9 〔式中、A 7 は -O-、-S-、-SO-、 $-SO_2-$ 、-N (R^{10}) - (式中、 R^{10} は水素原子、 C_1-C_6 アルキルカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルカルボニル基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホ $-C_6$ アルキルスルホニル基を示す。)、 $-C_6$ アルキルスルホニル基を示す。)、 $-C_6$ アルキルスルホニルスルホニル基を示す。)、 $-C_6$ アルキル基を示す。)を示し、 $-C_6$ アルキル基を示す。)を示し、

- (1) A^7 が-O-、-S-又は-N(R^{10})-(式中、 R^{10} は前記に同じ。) を示す場合、 R^9 は C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 シ クロアルキル基、ハロ C₃-C₆シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっ 10 ても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキ ルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルス 15 ルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル C_1 - C_4 アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル 基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフ ィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル 20 基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を環上 に有する置換フェニル C_1 - C_4 アルキル基、複素環基又は同一若しくは異なって も良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルス
 - (2) A^7 が-SO-、 $-SO_2-$ 、-C (=O) -又は-C (=NOR 2)- (式中、 R^2 は前記に同じ。)を示す場合、 R^9 は C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1

25 ルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホ

ニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示し、

 $-C_6$ アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6

- 5 $-C_6$ アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキ
- 10 ルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。〕を示し、 ℓ は $1\sim 4$ の整数を示す。)を示す。 p は、
- (1) QがQ¹を示す場合、 $1\sim 4$ の整数を示し、R⁷ はヘテロ環上の隣り合った炭素原子と一緒になって、 $1\sim 3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $5\sim 7$ 員環を形成することもでき、更に、R⁷ は結合しているヘテロ環の同一炭素原子と一緒になって $1\sim 3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $3\sim 7$ 員環を形成することもできる、
- **20** (2) Qが Q^3 を示す場合、 $1\sim 2$ の整数を示し、 R^7 はヘテロ環上の隣り合った炭素原子と結合して、 $1\sim 3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $5\sim 7$ 員環を形成することもでき、
 - (3) QがQ 4 を示す場合、 $1\sim 2$ の整数を示す。)請求項1 記載のベンズアミド誘導体。
- 25 3. QがQ³、Q⁴YはQ⁵を示す請求項2記載のベンズアミド誘導体。
 - 4. QがQ 1 を示し、Wが酸素原子を示す請求項2 記載のベンズアミド誘導体。
 - 5. B^1 、 B^2 、 B^3 及び B^4 が同時に炭素原子を示す請求項4記載のベンズアミド誘導体。

WO 01/00599 PCT/JP00/04135

56

- 6. 請求項1~5いずれか1項記載のベンズアミド誘導体を有効成分として 含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。
- 7. 有用作物から害虫を防除するために請求項6記載の農園芸用殺虫剤の有効量を対象作物又は土壌に処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用方法。

5

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/04135

	Int. C07D 43/8	279/04, C07D233/64, C07D413/12, (6, A01N 43/54		0, C07D265/08, 01N 43/78, A01N			
		International Patent Classification (IPC) or to both nat	tional classification and IPC	····			
		SEARCHED					
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl ⁷ C07D263/00, C07D277/00, C07D233/00, A01N43/00							
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched							
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CAPLUS, REGISTRY (STN)							
C.	DOCUM	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT					
Cat	egory*	Citation of document, with indication, where ap	propriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.			
	A	WO, 96/4278, Al (Nippon Soda Co 15 February, 1996 (15.02.96), Claims; implementation example & EP, 776894, Al & US, 59626 & US, 6107251, A	585, A	1-7			
<u> </u>		r documents are listed in the continuation of Box C.	See patent family annex.	mutional filing date or			
* "A"	docume	categories of cited documents: ant defining the general state of the art which is not	"T" later document published after the inte- priority date and not in conflict with the	e application but cited to			
"E"		red to be of particular relevance document but published on or after the international filing	"X" understand the principle or theory und document of particular relevance; the				
"L"	date	ent which may throw doubts on priority claim(s) or which is	considered novel or cannot be conside step when the document is taken alone	red to involve an inventive			
	cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)		"Y" document of particular relevance; the considered to involve an inventive step	when the document is			
"0"	means		combined with one or more other such combination being obvious to a persor	skilled in the art			
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed			"&" document member of the same patent				
Date of the actual completion of the international search 12 September, 2000 (12.09.00)			Date of mailing of the international sear 26 September, 2000	ch report (16.09.00)			
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office			Authorized officer				
Facsimile No.			Telephone No.				

国際出願番号 PCT/JP00/04135

	BWMTWD					
A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC)) Int. Cl'CO7D263/10, CO7D263/32, CO7D277/10, CO7D277/30, CO7D265/08, CO7D279/04, CO7D233/64, CO7D413/12 CO7D417/12, AO1N 43/76, AO1N 43/78, AO1N 43/86, AO1N 43/54						
B. 調査を行った分野						
調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))						
I n t. C 1 7 C07D263/00, C07D277/00, C07D233/00, A01N43/00						
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの						
国際調査で使用	目した電子データベース(データベースの名称、	調査に使用した用語)				
CAPLUS, REGISTRY (STN)						
C. 関連する	5と認められる文献					
引用文献の		・たみ、その眼球ナス体系の末二	関連する			
カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連すると	さは、その関連する箇所の表示	請求の範囲の番号			
Α	WO, 96/4278, A1 (日本 (15.02.96)	曹達株式会社)15.2月.1996	1-7			
	請求項及び実施例参照。 & EP,776894,A1 & US,596268	25, A & US, 6107251, A				
	to the district TOTAL to be seen a 7	「 パニン・レフー ミリー に関子で見	ler +. do PZ			
□ C欄の続きにも文献が列挙されている。 □ パテントファミリーに関する別紙を参照。						
もの 「E」国際出別	車のある文献ではなく、一般的技術水準を示す 頭日前の出願または特許であるが、国際出願日	出願と矛盾するものではなく、? の理解のために引用するもの	発明の原理又は理論			
	公表されたもの 主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行	「X」特に関連のある文献であって、 の新規性又は進歩性がないと考				
日若しく	くは他の特別な理由を確立するために引用する	「Y」特に関連のある文献であって、	当該文献と他の1以			
「〇」口頭に。	里由を付す) よる開示、使用、展示等に言及する文献 頃日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願	上の文献との、当業者にとって よって進歩性がないと考えられ 「&」同一パテントファミリー文献				
国際調査を完	了した日 12.09.00	国際調査報告の発送日 26.09.(00			
	の名称及びあて先	特許庁審査官(権限のある職員)	4 P 7 8 2 2			
	国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号100-8915	横尾 俊一	ı . ———————————————————————————————————			
	部千代田区霞が関三丁目4番3号	電話番号 03-3581-1101	内線 3490			

This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

□ BLACK BORDERS
□ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
□ FADED TEXT OR DRAWING
□ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
□ SKEWED/SLANTED IMAGES
□ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
□ GRAY SCALE DOCUMENTS
□ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
□ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

OTHER:

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.